

PATENT ABSTRACTS OF JAPAN

(11)Publication number : 04-173727

(43)Date of publication of application : 22.06.1992

(51)Int.Cl.

A61K 7/16

A61K 7/22

(21)Application number : 02-300705

(71)Applicant : LION CORP

(22)Date of filing : 06.11.1990

(72)Inventor : MORISHIMA SEIJI

(54) COMPOSITION FOR ORAL CAVITY

(57)Abstract:

PURPOSE: To prevent coloring and discoloration due to decomposition of colored substances by blending a composition for the oral cavity containing an ascorbic acid derivative with a polishing agent and simultaneously a coloring inhibitor such as a citrate, a phosphate, etc.

CONSTITUTION: A composition for the oral cavity is obtained by blending an ascorbic acid derivative selected from ascorbic acid phosphate, ascorbic acid sulfate and salts thereof with a polishing agent such as aluminum hydroxide, calcium carbonate, silica or silicates and simultaneously one or two or more coloring inhibitors selected from citrates, phosphates, carbonates, bicarbonates, alkali and alkaline earth metallic hydrates, basic amino acids and salts thereof and amine compounds. The aforementioned composition is capable of preventing coloring and discoloration due to decomposition of colored substances and enhancing merchandise value.

LEGAL STATUS

[Date of request for examination]

[Date of sending the examiner's decision of rejection]

[Kind of final disposal of application other than the examiner's decision of rejection or application converted registration]

[Date of final disposal for application]

[Patent number]

[Date of registration]

[Number of appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of requesting appeal against examiner's decision of rejection]

[Date of extinction of right]

⑫ 公開特許公報(A) 平4-173727

⑤ Int. Cl.⁵A 61 K 7/16
7/22

識別記号

庁内整理番号

7252-4C
7252-4C

⑬ 公開 平成4年(1992)6月22日

審査請求 未請求 請求項の数 1 (全5頁)

⑭ 発明の名称 口腔用組成物

⑮ 特 願 平2-300705

⑯ 出 願 平2(1990)11月6日

⑰ 発 明 者 森 嶋 清 二 神奈川県小田原市浜町1-6-42-305

⑱ 出 願 人 ライオン株式会社 東京都墨田区本所1丁目3番7号

⑲ 代 理 人 弁理士 小島 隆司

明 細 書

1. 発明の名称

口腔用組成物

2. 特許請求の範囲

1. アスコルビン酸リン酸エステル、アスコルビン酸硫酸エステル及びそれらの塩から選ばれるアスコルビン酸誘導体を含有する口腔用組成物に研磨剤を配合すると共に、クエン酸塩、リン酸塩、炭酸塩、重炭酸塩、アルカリ及びアルカリ土類金属の水和物、塩基性アミノ酸及びその塩、並びにアミン化合物から選ばれる着色抑制剤の1種又は2種以上を配合したことを特徴とする口腔用組成物。

3. 発明の詳細な説明

(産業上の利用分野)

本発明は、アスコルビン酸リン酸エステル、アスコルビン酸硫酸エステル及びそれらの塩から選ばれるアスコルビン酸誘導体を有効成分として配合した口腔用組成物に関し、更に詳述すると上記アスコルビン酸誘導体を配合した際に生ずる着色

を抑制した口腔用組成物に関する。

(従来の技術及び発明が解決しようとする課題)

アスコルビン酸は生体中で種々の酵素活性発現に重要な役割を演じ、多様な生理活性をもつことが知られている。特に、プロリル及びリジルヒドロキシラーゼの補酵素として作用し、コラーゲン合成に必須であるとされている。このため、コラーゲンの破壊を伴う歯肉炎、歯周炎の予防、治療に有用で、従来よりアスコルビン酸やその塩を口腔用組成物に配合することが知られている。

しかし、アスコルビン酸は強い還元性物質であるため、水溶液中では極めて不安定で練歯磨等の口腔用組成物に配合することは実用上困難である。このようなことから、近年化学的に安定なアスコルビン酸誘導体が種々開発され、特にアスコルビン酸リン酸エステル、アスコルビン酸硫酸エステル及びそれらの塩が注目されており、これらアスコルビン酸リン酸エステル類(特開昭52-79032号、同62-96408号、同62-273910号、同63-141921号公報)やアスコルビン酸硫酸エステル類

(特開昭62-273910号, 同63-141921号公報)を口腔用組成物に配合することが提案されている。

しかしながら、アスコルビン酸リン酸エステル類やアスコルビン酸硫酸エステル類を口腔用組成物に配合した場合、視覚的に明らかな着色が生じ、長期間保存することにより変色が生じる。この場合、上記特開昭63-141921号公報では、水溶性亜鉛塩類を配合し、長期間保存しても変色を生じないようにすることを提案しているが、上記着色を防止することは述べておらず、このため更にアスコルビン酸リン酸エステル類やアスコルビン酸硫酸エステル類の配合に伴う口腔用組成物の着色を効果的に防止する方法の開発が望まれる。

(課題を解決するための手段及び作用)

本発明者は上記要望に応えるため種々検討を行なった結果、アスコルビン酸リン酸エステル及びアスコルビン酸硫酸エステル並びにそれらの塩から選ばれるアスコルビン酸誘導体に水酸化アルミニウム、炭酸カルシウム、シリカ、シリケート等の研磨剤を配合すると共に、クエン酸塩、リン酸

塩、炭酸塩、重炭酸塩、アルカリ及びアルカリ土類金属の水和物、塩基性アミノ酸及びその塩、並びにアミン化合物から選ばれる着色抑制剤の1種又は2種以上を配合した場合、口腔用組成物の着色、更にその着色物の分解に基づく変色を効果的に抑制し得ることを知見し、本発明をなすに至ったものである。

なお、上述したようにアスコルビン酸リン酸エステル類やアスコルビン酸硫酸エステル類を口腔用組成物に配合することは公知であり、特に特開昭63-141921号公報は水溶性亜鉛塩類の使用により変色を防止することを提案しているが、かかる亜鉛塩類を配合せず、研磨剤を配合し、更に上記着色抑制剤を配合することにより、アスコルビン酸リン酸エステル類やアスコルビン酸硫酸エステル類による着色を防止するということは、本発明者の新知見に係るものである。

以下、本発明につき更に詳しく説明する。

本発明の口腔用組成物に配合されるアスコルビン酸リン酸エステル及び硫酸エステルとしては、

アスコルビン酸の2位、3位、5位、6位の水酸基のいずれか一つ又は二つ以上がリン酸エステルや硫酸エステルになったものが使用できる。例えば、L-アスコルビン酸-2-リン酸エステル、L-アスコルビン酸-3-リン酸エステル、L-アスコルビン酸-6-リン酸エステル、L-アスコルビン酸-2-硫酸エステル、L-アスコルビン酸-3-硫酸エステル、L-アスコルビン酸-6-硫酸エステル等が挙げられる。また、それらの塩類としては、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩等が挙げられる。これらアスコルビン酸リン酸エステル及び硫酸エステル類はその1種を単独で又は2種以上を組み合わせ使用することができる。

上記アスコルビン酸リン酸エステル及び硫酸エステル類の配合量は、種々選定されるが、組成物全体の0.001~10% (重量%、以下同じ)の範囲とすることが好ましく、より好ましくは0.01~5%である。

本発明は、上記アスコルビン酸誘導体を含む口

腔用組成物に研磨剤を加えると共に、特定の着色抑制剤を配合したものである。

ここで、研磨剤としては、水酸化アルミニウム、第2リン酸カルシウム(2水和物及び無水物)、第1リン酸カルシウム、第3リン酸カルシウム、炭酸カルシウム、シリカ、シリケート、不溶性メタリン酸ナトリウム、第3リン酸マグネシウム、硫酸カルシウム等を挙げることができ、とりわけ水酸化アルミニウム、炭酸カルシウム、シリカ、シリケートが好適に用いられる。

なお、水酸化アルミニウムは通常のものでよく、リン酸等の酸で改質したものでもよい。また、炭酸カルシウムとしては、軽質、重質のいずれでもよいが、重質炭酸カルシウムが好ましい。更に、シリカとしては、水和沈澱シリカ、シリカキセロゲル、シリカエーロゲル等が挙げられ、シリケートとしてはアルミノシリケート、ジルコノシリケート(好適にはZr量0.1~10%、特0.2~2%)等が好ましい。

上記研磨剤はその1種を単独に又は2種以上を

併用して用いることができるが、配合量は組成物全体の5～90%、特に10～60%とすることが好ましく、5%より配合量が少いと着色防止効果が十分発揮されない場合がある。

また、着色抑制剤としては、水溶性のリン酸塩、炭酸塩、重炭酸塩、クエン酸塩、アルカリ及びアルカリ土類金属の水和物、アミン化合物、塩基性アミノ酸及びその塩の1種又は2種以上が使用できる。これらの中では、リン酸2ナトリウム等のリン酸塩、クエン酸3ナトリウム等のクエン酸塩が着色抑制効果の点から好適である。

上記着色抑制剤の使用量は、組成物全体の0.001%以上、特に0.01%以上配合することが着色抑制効果の点から好ましく、また上限は使用感の点から10%、特に5%である。なお、組成物のpHを7～9の範囲に調整することにより、着色抑制効果もより有効に発揮される。

本発明の口腔用組成物には、更にその種類等に応じた適宜な成分を配合することができる。例えば、歯磨剤を得る場合には、粘結剤、粘稠剤、界

面活性剤、甘味剤、香料、防腐剤、各種有効成分を配合することができる。

〔発明の効果〕

本発明の口腔用組成物によれば、アスコルビン酸リン酸エステル類又はアスコルビン酸硫酸エステル類の配合による着色、更にはその着色物の分解による変色を防止し得、商品価値を高めることができる。

次に、実験例を示し、本発明の効果を具体的に説明する。

〔実験例1〕

第1表に示す研磨剤4gに蒸留水又は同表に示す着色抑制剤の0.3%水溶液1mL、60%ソルビット溶液2.0mL、5%ラウリル硫酸ナトリウム溶液1.0mL及び0.5%アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩溶液又は0.5%アスコルビン酸硫酸エステルジカリウム塩溶液1.0mLを加えた。

次に、上記混合液(試料)を40℃で24時間放置し、遠心上清の450nmの吸光度を測定して

着色度合を調べ、下記式から着色抑制率を算出した。

$$\text{着色抑制率} = \frac{\text{コントロールのOD}_{450} - \text{試料のOD}_{450}}{\text{コントロールのOD}_{450}} \times 100$$

但し、コントロールは研磨剤及び着色抑制剤を含有しない混合液である。

第1表

アスコルビン酸誘導体	研磨剤	着色抑制剤	pH	着色抑制率(%)
アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩	水酸化アルミニウム	—	7.39	69.4
	"	リン酸2ナトリウム	7.94	90.2
	"	クエン酸3ナトリウム	8.12	93.2
アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩	炭酸カルシウム	—	8.41	86.2
	"	リン酸2ナトリウム	8.82	100.0
	第2リン酸カルシウム水和物	—	6.72	56.1
アスコルビン酸硫酸エステルジカリウム塩	シリカ	リン酸2ナトリウム	7.48	83.1
	"	リン酸2ナトリウム	6.87	64.8
	"	リン酸2ナトリウム	7.62	91.4
アスコルビン酸硫酸エステルジカリウム塩	水酸化アルミニウム	—	7.29	64.9
	"	リン酸2ナトリウム	7.86	93.6
	"	クエン酸3ナトリウム	8.01	96.5

第1表から明らかなように、アスコルビン酸誘導体類に研磨剤を配合することにより着色がある程度抑制でき、更にクエン酸塩、リン酸塩を加えることによりその効果が高まることが認められる。
(実験例2)

下記処方 of 歯磨剤を調製し、これをラミネートチューブに充填し、40℃で24時間放置した後、歯磨剤の着色程度を以下の判定基準により肉眼的に判定した。また、上記歯磨剤を50℃で1か月保存した後の保形性を下記基準により判定した。結果を第2表に示す。

歯磨剤処方

アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩	0.2%
第2表に示す研磨剤	45.0
ゲル化性シリカ	2.0
ソルビット	25.0
カルボキシメチルセルロースナトリウム	1.0
ラウリル硫酸ナトリウム	1.5
ショ糖モノパルミチン酸エステル	1.0

サッカリンナトリウム	0.2
エタノール	0.1
安息香酸ナトリウム	0.1
香料	1.0
第2表に示す着色抑制剤	第2表に示す量
精製水	バランス
計	100.0%

判定基準

着色度

着色なし:	—
わずかに着色を認める:	±
明らかに	+
著しく	++

保形性

良好:	○
歯ブラシよりやや流れおちる:	△
歯ブラシより流れおちる:	×

第2表

保形性	△	○	×	△	○	×	△	○
着色度	+	+	+	+	+	+	+	+
pH	7.36	8.24	8.18	7.62	8.18	6.86	7.64	7.81
着色抑制剤	—	0.5%リン酸2ナトリウム	0.5%クエン酸3ナトリウム	—	0.5%クエン酸3ナトリウム	—	0.5%リン酸2ナトリウム	0.5%クエン酸3ナトリウム
研磨剤	水酸化アルミニウム	水酸化アルミニウム	水酸化アルミニウム	炭酸カルシウム	炭酸カルシウム	第2リン酸カルシウム	第2リン酸カルシウム	シリカ

以下、実施例を示す。

(実施例1) 練歯磨

水酸化アルミニウム	45.0%
ゲル化性シリカ	2.0
ソルビット	25.0
カルボキシメチルセルロースナトリウム	1.0
ショ糖モノパルミテート	1.0
ラウリル硫酸ナトリウム	1.5
サッカリンナトリウム	0.2
エタノール	0.1
安息香酸ナトリウム	0.1
アスコルビン酸硫酸エステルジカルシウム塩	0.05
アスコルビン酸リン酸エステルマグネシウム塩	0.1
リン酸2ナトリウム	0.3
クエン酸3ナトリウム	0.1
香料	1.0
水	残
計	100.0%
pH	7.98

〔実施例 2〕練歯磨

沈降性シリカ	25.0%
ソルビット	25.0
グリセリン	25.0
ポリビニルピロリドン	1.0
ラウロイルポリグリセリン エステル	1.0
ポリオキシエチレン (60 モル) ソルビタンモノラウレート	0.5
サッカリンナトリウム	0.2
パラオキシ安息香酸エチル	0.1
クロルヘキシジン塩酸塩	0.1
アスコルビン酸リン酸エステル ナトリウム塩	0.05
リン酸 2 ナトリウム	0.5
香 料	1.0
水	残
計	100.0%
pH	8.12

〔実施例 3〕練歯磨

第 2 リン酸カルシウム・2 水和物	20.0%
炭酸カルシウム	20.0
沈降性シリカ	5.0
ポリオキシエチレン (40 モル) 硬化ヒマシ油	0.1
ソルビタンモノオレイン酸 エステル	1.0
ラウリル硫酸ナトリウム	0.2
グリチルレチン酸	0.1
サッカリンナトリウム	0.6
アスコルビン酸リン酸エステル マグネシウム塩	0.3
クエン酸 3 ナトリウム	0.3
香 料	0.8
水	残
計	100.0%
pH	8.16

ゲル化性シリカ	2.0
ソルビット	20.0
プロピレングリコール	2.5
カルボキシメチルセルロース ナトリウム	1.0
ラウロイルジエタノールアמיד	1.0
ラウリル硫酸ナトリウム	1.5
ラウロイルザルコシンナトリウム	0.3
サッカリンナトリウム	0.1
パラオキシ安息香酸エチル	0.1
アスコルビン酸リン酸エステル マグネシウム塩	0.2
クエン酸 3 ナトリウム	0.3
リン酸 2 ナトリウム	0.2
香 料	0.8
水	残
計	100.0%
pH	8.38

〔実施例 4〕口腔用バスタ

セタノール	10.0%
スクワラン	20.0

特許出願人 ライオン株式会社
代理人 小島 隆 司